



957

(19) BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENT- UND
MARKENAMT

(12) **Offenlegungsschrift**
(10) **DE 101 32 953 A 1**

(51) Int. Cl.⁷:
A 61 K 7/48
A 61 K 35/78

(21) Aktenzeichen: 101 32 953.9
(22) Anmeldetag: 6. 7. 2001
(43) Offenlegungstag: 16. 1. 2003

(71) Anmelder:
Beiersdorf AG, 20253 Hamburg, DE

(72) Erfinder:
Biergiesser, Helga, 21465 Reinbek, DE; Blatt, Thomas, Dr., 22880 Wedel, DE; Döring, Thomas, Dr., 22453 Hamburg, DE; Gallinat, Stefan, Dr., 22880 Wedel, DE; Stäb, Franz, Dr., 21379 Echem, DE; Venzke, Kirsten, 22303 Hamburg, DE

(56) Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht zu ziehende Druckschriften:

DE 198 58 670 C2
DE 33 17 439 C2
DE 41 30 324 A1
DE 27 49 274 A1
DE 27 49 273 A1
FR 27 53 374 A1
BE 10 11 858 A
US 61 13 926 A

WPID Abstract, AN 1995-291227/38 zu RU 2028796
C1;
JP Patent Abstracts of Japan:
2000226317 A;
2000044419 A;
11263629 A;
11246336 A;
11236334 A;
11228339 A;
11199500 A;
11079948 A;
10179157 A;
10072336 A;
09067245 A;
07061905 A;
06065045 A;
04018026 A;

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

(54) Verwendung von Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakten in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Prophylaxe gegen und Behandlung von degenerativen Hauterscheinungen

(57) Verwendung von Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakten in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome umweltbedingter negativer Hautveränderungen und/oder durch UV- und/oder Ozon- und/oder Smog und/oder Rauchen induzierten Hautschäden sowie entzündlicher und degenerativer Hautzuständen.

DE 101 32 953 A 1

DE 101 32 953 A 1

Beschreibung

[0001] Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von Hopfen-Extrakten bzw. Hopfen-Malz-Extrakten in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome umweltbedingter negativer Hautveränderungen z. B. durch UV- und oder Ozon- und oder Smog und oder Rauchen induzierten Hautschäden sowie entzündlicher und degenerativer Hautzuständen.

[0002] Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z. B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z. B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

[0003] Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

[0004] Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliches Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

[0005] Die chronologische Hautalterung wird z. B. durch endogene, genetisch determinierte Faktoren verursacht. In Epidermis und Dermis kommt es alterungsbedingt z. B. zu folgenden Strukturschäden und Funktionsstörungen, die auch unter den Begriff "Senile Xerosis" fallen können:

a) Trockenheit, Rauhigkeit und Ausbildung von Trockenheitsfältchen,
b) Juckreiz und
c) verminderte Rückfettung durch Talgdrüsen (z. B. nach Waschen).

[0006] Exogene Faktoren, wie UV-Licht und chemische Noxen, können kumulativ wirksam sein und z. B. die endogenen Alterungsprozesse beschleunigen bzw. sie ergänzen. In Epidermis und Dermis kommt es insbesondere durch exogene Faktoren z. B. zu folgenden Strukturschäden- und Funktionsstörungen in der Haut, die über Maß und Qualität der Schäden bei chronologischer Alterung hinausgehen:

d) Sichtbare Gefäßerweiterungen (Teleangiektasien, Cuperosis);
e) Schlaffheit und Ausbildung von Falten;
f) lokale Hyper-, Hypo- und Fehlpigmentierungen (z. B. Altersflecken) und
g) vergrößerte Anfälligkeit gegenüber mechanischem Stress (z. B. Rissigkeit).

[0007] Die vorliegende Erfindung betrifft insbesondere Produkte zur Pflege der durch Umweltnoxen wie z. B. UV-Licht, Ozon, Zigarettenrauch gestressten Haut, sowie zur Behandlung der Folgeschäden der Lichtalterung, insbesondere der unter a) bis g) aufgeführten Phänomene.

[0008] Produkte zur Pflege gealterter Haut sind an sich bekannt. Sie enthalten z. B. Retinoide (Vitamin A-Säure und/oder deren Derivate) bzw. Vitamin A und/oder dessen Derivate. Ihre Wirkung auf die Strukturschäden ist allerdings umfangsmäßig begrenzt. Darüber hinaus gibt es bei der Produktentwicklung oft erhebliche Schwierigkeiten, die Wirkstoffe in ausreichendem Maß gegen oxidativen Zerfall zu stabilisieren. Die Verwendung Vitamin A-Säurehaltiger Produkte bedingt ferner häufig starke erythematöse Hautreizungen. Retinoide sind daher nur in geringen Konzentrationen einsetzbar.

[0009] Insbesondere betrifft die vorliegende Erfindung kosmetische Zubereitungen mit einem wirksamen Schutz vor schädlichen Oxidationsprozessen in der Haut, aber auch zum Schutz kosmetischer Zubereitungen selbst bzw. zum Schutz der Bestandteile kosmetischer Zubereitungen vor schädlichen Oxidationsprozessen.

[0010] Die schädigende Wirkung des ultravioletten Teils der Sonnenstrahlung auf die Haut ist allgemein bekannt. In Abhängigkeit von ihrer jeweiligen Wellenlänge haben die Strahlen verschiedene Wirkungen auf das Organ Haut: Die sogenannte UV-C-Strahlung mit einer Wellenlänge, die kleiner als 290 nm ist, wird von der Ozonschicht in der Erdatmosphäre absorbiert und hat daher keine physiologische Bedeutung. Dagegen verursachen Strahlen im Bereich zwischen 290 nm und 320 nm, dem sogenannten UV-B-Bereich, ein Erythem, einen einfachen Sonnenbrand oder sogar mehr oder weniger starke Verbrennungen. Als ein Maximum der Erythema-wirksamkeit des Sonnenlichtes wird der engere Bereich um 308 nm angegeben.

[0011] Zum Schutz gegen UV-B-Strahlung sind zahlreiche Verbindungen bekannt, bei denen es sich beispielsweise um Derivate des 3-Benzylidencamphers, der 4-Aminobenzoësäure, der Zimtsäure, der Salicylsäure, des Benzophenons sowie des s-Triazins handelt.

[0012] Man hat lange Zeit fälschlicherweise angenommen, daß die langweilige UV-A-Strahlung mit einer Wellenlänge zwischen 320 nm und 400 nm nur eine vernachlässigbare biologische Wirkung aufweist. Inzwischen ist allerdings durch zahlreiche Studien belegt, daß UV-A-Strahlung im Hinblick auf die Auslösung photodynamischer, speziell phototoxischer Reaktionen und chronischer Veränderungen der Haut weitaus gefährlicher als UV-B-Strahlung ist. Auch kann der schädigende Einfluß der UV-B-Strahlung durch UV-A-Strahlung noch verstärkt werden.

[0013] So ist es u. a. erwiesen, daß selbst die UV-A-Strahlung unter ganz normalen Alltagshedingungen ausreicht, um innerhalb kurzer Zeit die Collagen- und Elastinfasern zu schädigen, die für die Struktur und Festigkeit der Haut von wesentlicher Bedeutung sind. Hierdurch kommt es zu chronischen lichtbedingten Hautveränderungen – die Haut "altert" vorzeitig. Zum klinischen Erscheinungsbild der durch Licht gealterten Haut gehören beispielsweise Falten und Fältchen sowie ein unregelmäßiges, zerfurchtes Relief. Ferner können die von lichtbedingter Hautalterung betroffenen Partien eine unregelmäßige Pigmentierung aufweisen. Auch die Bildung von braunen Flecken, Keratosen und sogar Karzinomen bzw. malignen Melanomen ist möglich. Eine durch die alltägliche UV-Belastung vorzeitig gealterte Haut zeichnet sich außerdem durch eine geringere Aktivität der Langerhanszellen und eine leichte, chronische Entzündung aus.

[0014] Etwa 90% der auf die Erde gelangenden ultravioletten Strahlung besteht aus UV-A-Strahlen. Während die UV-

B-Strahlung in Abhängigkeit von zahlreichen Faktoren stark variiert (z. B. Jahres- und Tageszeit oder Breitengrad), bleibt die UV-A-Strahlung unabhängig von jahres- und tageszeitlichen oder geographischen Faktoren Tag für Tag relativ konstant. Gleichzeitig dringt der überwiegende Teil der UV-A-Strahlung in die lebende Epidermis ein, während etwa 70% der UV-B-Strahlen von der Hornschicht zurückgehalten werden.

[0015] Es ist daher von grundsätzlicher Wichtigkeit, daß kosmetische und dermatologische Lichtschutzzubereitungen sowohl gegen UV-B- als auch gegen UV-A-Strahlung ausreichenden Schutz bieten. 5

[0016] UV-Strahlung kann aber auch zu photochemischen Reaktionen führen, wobei dann die photochemischen Reaktionsprodukte in den Hautmetabolismus eingreifen. Ferner zählt UV-Strahlung zur ionisierenden Strahlung. Es besteht also das Risiko, daß auch ionische Spezies bei UV-Exposition entstehen, welche dann ihrerseits oxidativ in die biochemischen Prozesse einzutreten vermögen. 10

[0017] Es ist darüber hinaus bekannt, daß in der menschlichen und tierischen Haut unerwünschte Oxidationsprozesse auftreten können. Im Aufsatz "Skin Diseases Associated with Oxidative Injury" in "Oxidative Stress in Dermatology", S. 323 ff. (Marcel Decker Inc., New York, Basel, Hong Kong, Herausgeber: Jürgen Fuchs, Frankfurt, und Lester Packer, Berkeley/Californien), werden derartige oxidative Schäden der Haut und ihre näheren Ursachen aufgeführt.

[0018] Antioxidantien werden zwar hauptsächlich als Schutzsubstanzen gegen den Verderb der sie enthaltenden Zubereitungen verwendet. Allerdings können Antioxidantien und/oder Radikalfänger auch in kosmetischen bzw. dermatologischen Formulierungen eingesetzt werden, um Oxidationsreaktionen abzuhalten bzw. vorzubeugen. 15

[0019] So ist bereits in den US-Patentschriften 4,144,325 und 4,248,861 sowie in zahlreichen anderen Dokumenten vorgeschlagen worden, Vitamin E – eine Substanz mit bekannter antioxidativer Wirkung in Lichtschutzformulierungen – einzusetzen, dennoch bleibt auch hier die erzielte Wirkung weit hinter der erhofften zurück. 20

[0020] Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es daher, die Nachteile des Standes der Technik zu vermeiden und insbesondere die durch Umweltnoxen verursachten Schäden dauerhaft, nachhaltig und ohne das Risiko von Nebenwirkungen zu beheben bzw. ihnen vorzubeugen.

[0021] Weitere Aufgabe der Erfindung war es, kosmetische, dermatologische und pharmazeutische Wirkstoffe und Zubereitungen sowie Lichtschutzformulierungen zu schaffen, die zur Prophylaxe und Behandlung lichtempfindlicher Haut, insbesondere von Photodermatosen, bevorzugt der polymorphen Lichidermatose dienen. 25

[0022] Dicsen Übelständen abzuhelfen, war Aufgabe der vorliegenden Erfindung.

[0023] Es hat sich überraschenderweise herausgestellt, daß die Verwendung von Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakten in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome umweltbedingter negativer Hautveränderungen und/oder durch UV- und/oder Ozon- und/oder Smog und/oder Rauchen induzierten Hautschäden sowie entzündlicher und degenerative Hautzustände den Nachteilen des Standes der Technik abhilft. 30

[0024] Bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,0005 bis 50 Gew.-%, bevorzugt 0,01 bis 20 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,01 bis 5 Gew.-% an Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakten, jeweils bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen.

[0025] Hopfen-Extrakt im Sinne der vorliegenden Erfindung wird aus botanisch bekannten Hopfenarten (Humulus Lupulus, Familie der Cannabaceae) durch Extraktion gewonnen. 35

[0026] Vorteilhafter erfundungsgemäßer Hopfenextrakt (Hopfenzapfen- und Hopfendrüsenextrakte) enthält typischerweise einige oder alle der folgenden Inhaltsstoffe:

– Hopfenbitterstoffe: Humulone, Lupulone

40

Die Bitterstoffe sind Monoacylphloroglucide mit Dimethylallyl-Seitenketten.

Nach der Anzahl der Dimethylallyl-Seitenkette unterscheidet man zwischen Humulone (α -Säuren) mit zwei und Lupulone (β -Säuren) mit drei Dimethylallyl-Seitenketten.

– Gesamtharze (Methanol- und Etherlösliche Fraktion)

45

Man unterscheidet zwischen Weichharzen (hexanlöslich) und Hartharzen (hexanunlöslich).

Lipophile Hopfenextrakte enthalten 2-Methyl-3-buten-2-ol, während mit polaren Lösungsmitteln bereitete Hopfenextrakte frei von 2-Methyl-3-buten-2-ol sind.

– Polyphenole machen je nach Hopfensorte, Provenienz und Lagerzustand 4 bis 14 Gew.-% der Trockensubstanz aus.

50

– Phenolcarbonsäuren, wie Ferulasäure, Gallussäure, Kaffeesäure, para-Cumarsäure, para-Hydroxybenzoësäure, Protocatechusäure, Vanillinsäure frei und glycosidisch gebunden, Chlorogensäure, Neochlorogensäure.

– Flavanone/Chalkone (Xanthohumol, Isoxanthohumol, Desmethylxanthohumol, 3-Isoprenyl-2-4-Dihydroxy-4,6-dimethoxychalkon und 2,6-Dimethoxy-4,4-dihydroxychalkon)

– Flavonole: Astragalin, Kämpferol und Quercetin-3-glycoside

55

– Catechine: Catechin, Epicatechin

– Proanthocyanidine (Leucocyanidin, Leucodelphinidin)

– kondensierte Gerbstoffe

– Ätherische Öle: Terpenkohlenwasserstoffen, Myrcen, Ilumulen, β -Caryophyllen, 2-Undecanon

– Phytosterole

60

– Phytoöstrogene

– Glucide

– Tannine.

[0027] Die Zusammensetzung der erfundungsgemäßen Hopfen-Extrakte, d. h. beispielsweise die Gesamtharzmenge, der Weichharz-/Hartharzanteil, der Gehalt an α - (3 bis 12 Gew.-%) bzw. β - (3 bis 5 Gew.-%) Säuren sowie das Verhältnis der Humulon- und Lupulon-Homologen ist abhängig von der Hopfensorte, dem Anbaugebiet, dem Erntezeitpunkt, der Trocknung und der Lagerung des Hopfens. 65

[0028] Die Hopfen-Extrakte im Sinne der vorliegenden Erfindung können wasserlöslich oder öllöslich sein.

DE 101 32 953 A 1

[0029] Je nach verwendetem Lösungsmittel und Extraktionsverfahren ist es möglich, aus Hopfenzapfen sowie Hopfendrüsen wasserlösliche oder öllösliche Hopfen-Extrakte herzustellen.

[0030] Dazu wird die frische Frucht (weibliche Blüten) oder die getrocknete Pflanze, beispielsweise nach einem der folgenden bekannten Verfahren extrahiert:

- 5 1. Ein vorteilhaftes Extraktionsmittel zur Herstellung wasserlöslicher Extrakte ist beispielsweise – aber nicht ausschliesslich – 1,2-Propylenglykol:
 - 10 1 Teil getrocknete, gemahlene Drogenmischung wird mit 10 Teilen Extraktionsmittel versetzt und bei schonender Temperatur über einen festgelegten Zeitrahmen gerührt; danach wird abzentrifugiert. Dem Zentrifugat wird nochmals 1 Teil trockenes Drogenmaterial zugesetzt und der Extraktionsvorgang wiederholt. Die festen Bestandteile werden wieder abzentrifugiert und der Pflanzenextrakt mit 5 Atmosphären Druck steril filtriert.
 - 15 2. Die Herstellung öllöslicher Extrakte erfolgt vorzugsweise beispielsweise – aber nicht ausschliesslich – mit Sonnenblumenöl, Sojaöl, Diisobutyladipat.
 3. Ferner sind je nach gewünschten Inhaltsstoffen auch die folgenden, aus der Literatur bekannte, Extraktionsverfahren vorteilhaft, aber nicht ausschliesslich, anwendbar:
 - Extraktion mit Dichlormethan, mit Kohlendioxid
 - Alkoholische oder hydroalkoholische Extraktion
 - Fluidextrakt: 1 : 1 in Ethanol
 - Tinktur: 1 : 5 in Ethanol 60%.

20 [0031] Die Liste der genannten Extraktionsverfahren soll selbstverständlich nicht limitierend sein. Erfindungsgemäße Hopfen-Extrakte sind auf zahlreichen, an sich bekannten Wegen erhältlich. Zur Herstellung der Extrakte sind auch neue Wege prinzipiell denkbar. Wesentlich dabei ist, daß die Hopfen-Extrakte die erfundungsgemäßen Eigenschaften zeigen.

25 [0032] Bei Anwendung des erfundungsgemäß verwendeten Wirkstoffes bzw. kosmetischer oder topischer dermatologischer Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfundungsgemäß verwendetem Wirkstoff ist in überraschender Weise eine wirksame Behandlung, aber auch eine Prophylaxe

- von defizitären, sensitiven oder hypoaktiven Hautzuständen oder defizitären, sensitiven oder hypoaktiven Zuständen von Hautanhängsgebilden,
- 30 – von bestimmten degenerativen Erscheinungen der Haut (z. B. Hauterschlaffung, Altersflecken, Teleangiektasien, Störung der Osmolytbalance, des natürlichen Haut-pH-Wertes sowie Schwund der epidermalen und dermalen Zellschichten, der Bestandteile des Bindegewebes, der Retezapfen und Kapillargefäße der Haut) und/oder der Hautanhängsgebilde,
- 35 – von umweltbedingten (durch Rauchen, Smog, reaktive Sauerstoffspezies, freie Radikale verursachten) und insbesondere lichtbedingten negativen Veränderungen der Haut und der Hautanhängsgebilde,
- von lichtbedingten Hautschäden und UV-induzierter Immunsuppression,
- bei verringelter Hautdicke,
- von Hauterschlaffung und Hautermüdung,
- bei Störungen des normalen Haut-pH's und der Osmolytbalance,
- 40 – von Pigmentierungsstörungen,
- von Juckreiz,
- von Hornschichtbarrierestörungen, bei Veränderungen des transepidermalen Wasserverlustes und des normalen Feuchtigkeitsgehaltes der Haut,
- bei Veränderungen der normalen Lipidperoxidationen,
- 45 – von Haarausfall und für verbessertes Haarwachstum,
- bei Abweichungen von der normalen Zell-Zell-Kommunikation in der Haut,
- bei Veränderungen der normalen Fibroblasten- und Keratinozytenproliferation,
- bei Veränderungen der normalen Fibroblasten- und Keratinozytendifferenzierung,
- 50 – von entzündlichen Hautzuständen sowie atopischem Ekzem, seborrhoischem Ekzem, polymorpher Lichtdermatose, Psoriasis, Vitiligo

möglich.

[0033] Der erfundungsgemäß verwendete Wirkstoff bzw. kosmetischer oder topischer dermatologischer Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfundungsgemäßem verwendetem Wirkstoff dienen aber auch in überraschender Weise

- 55 – zur Beruhigung von empfindlicher oder gereizter Haut,
- zur Aufrechterhaltung der normalen Kollagen-, Hyaluronsäure-, Elastin- und Glycosaminoglycan-Homeostase,
- bei gesteigerter Aktivierung proteolytischer Enzyme in der Haut, wie z. B. Metalloproteinasen,
- zur Stimulation der intrazellulären DNA-Synthese, insbesondere bei defizitären oder hypoaktiven Hautzuständen,
- 60 – bei Wundheilungsstörungen,
- zur Steigerung der Zellerneuerung und Regeneration der Haut,
- zur Steigerung der hauteigenen Schutz- und Reparaturmechanismen (beispielsweise für dysfunktionelle Enzyme, DNA, Lipide, Proteine),
- 65 – zur Vor- und Nachbehandlung bei topischer Anwendung von Laser- und Abschleifbehandlungen, die z. B. der Reduzierung von Hautfalten und Narben dienen, um den resultierenden Hautreizungen entgegenzuwirken und die Regenerationsprozesse in der verletzten Haut zu fördern.

[0034] Es ist erfindungsgemäß äußerst vorteilhaft, den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff bzw. kosmetische oder topische dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff zur kosmetischen oder dermatologischen Behandlung oder Prophylaxe unerwünschter Hautzustände zu verwenden. 5

[0035] Vorteilhaft kann der erfindungsgemäß verwendete Wirkstoff eingearbeitet werden in übliche kosmetische und dermatologische Zubereitungen, welche in verschiedenen Formen vorliegen können. Die Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können bevorzugt neben einer oder mehrerer Ölphasen (in welche das Cardiolipin vorzugsweise eingearbeitet wird) zusätzlich eine oder mehrere Wasserphasen enthalten und beispielsweise in Form von W/O-, O/W-, multiplen (W/O/W-, O/W/O-) Emulsionen vorliegen. Solche Formulierungen können vorzugsweise auch eine Mikroemulsion, eine Feststoff-Emulsionen (d. h. eine Emulsion, welche durch Feststoffe stabilisiert ist, z. B. eine Pickering-Emulsion), eine sprühbare Emulsion, eine Hydrodispersion oder Lipodispersion sein. 10

[0036] Ferner kann der erfindungsgemäß verwendete Wirkstoff vorteilhaft in eine Lösung, ein Gel, einen festen Stift oder auch ein Aerosol eingearbeitet werden. 10

[0037] Bevorzugt stellen die erfindungsgemäßen Emulsionen O/W-Emulsionen dar.

[0038] Besonders vorteilhafte Zubereitungen werden ferner erhalten, wenn als Zusatz- oder weitere Wirkstoffe Antioxidantien eingesetzt werden. Erfindungsgemäß enthalten die Zubereitungen vorteilhaft eines oder mehrere Antioxidantien. Als günstige, aber dennoch fakultativ zu verwendende Antioxidantien können alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden. 15

[0039] Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B. α -Carotin, β -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amin-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z. B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z. B. pmol bis μ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z. B. α -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxsäuren (z. B. Zitronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B. γ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin A-palmitat) sowie Konyferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajartsäure, Trihydroxybutyrophonen, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z. B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe. 20

[0040] Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung können wasserlösliche Antioxidantien eingesetzt werden, wie beispielsweise Vitamine, z. B. Ascorbinsäure und deren Derivate. 30

[0041] Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 bis 20 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung. 40

[0042] Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen. 45

[0043] Sofern Vitamin A bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

[0044] Es ist dabei ebenfalls von Vorteil, den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff als Zusatzstoff zu Zubereitungen zu geben, die bereits andere Wirkstoffe für andere Zwecke enthalten. 50

[0045] Erfindungsgemäß können weitere Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) auch sehr vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der lipophilen Wirkstoffe, insbesondere aus folgender Gruppe: alpha-Liponsäure, Phytoen, D-Biotin, Coenzym Q10, alpha Glucosyrlutin, Carnitin, Carnosin, Isoflavon, Kreatin, Taurin. 55

[0046] Es ist auch vorteilhaft, wenngleich selbstverständlich nicht zwingend, den erfindungsgemäßen Wirkstoff in verkapselfter Form darzureichen, z. B. in Kollagenmatrices und anderen üblichen Verkapselungsmaterialien, z. B. als Celluloseverkapselungen, in Gelatine, Wachsmatrices oder liposomal verkapselft. Insbesondere Wachsmatrices wie sie in der DE-OS 43 08 282 beschrieben werden, haben sich als günstig herausgestellt. Besonders vorteilhafte Verkapselungsformen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner Cyclodextrinkomplexe von Cardiolipin.

[0047] Ferner kann es von Vorteil sein, den erfindungsgemäßen Wirkstoff z. B. als sogenannte solid lipid nanoparticles mit Hilfe von aufgeschmolzenen Wachsen zu verkapselfn, die unter anderem, aber nicht ausschließlich, gewählt sein können aus der Gruppe der Esterwachse, Triglyceridwachse oder Kohlenwasserstoffwachse. Weiterhin kann es von Vorteil sein die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Polymere zu verkapselfn, z. B. in Partikel auf Basis hochvernetzter Polymethacrylate und/oder Cellulosetriacetate und/oder als Core/Shell-Partikel mit einer Hülle aus Poly(oxymethylurea), Nylon, Polyamide, Polyurethan, Polyester, Gelatine und Polyolefine. 60

[0048] Die Prophylaxe bzw. die kosmetische oder dermatologische Behandlung mit dem erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff bzw. mit den kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff erfolgt in der üblichen Weise, und zwar dergestalt, daß der erfindungsgemäß verwendete Wirkstoff bzw. die kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen 65

Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff auf die betroffenen Hautstellen aufgetragen wird.

[0049] Erfindungsgemäß Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung, z. B. in Form einer Crème, einer Lotion, einer kosmetischen Milch sind vorteilhaft und enthalten z. B. Fette, Öle, Wachse und/oder andere Fettkörper, sowie Wasser und einen oder mehrere Emulgatoren, wie sie üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet werden.

[0050] Es ist auch möglich und vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff in wäßrige Systeme bzw. Tensidzubereitungen zur Reinigung der Haut und der Haare einzufügen.

[0051] Es ist dem Fachmann natürlich bekannt, daß anspruchsvolle kosmetische Zusammensetzungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Darunter zählen beispielsweise Konsistenzgeber, Füllstoffe, Parfum, Farbstoffe, Emulgatoren, zusätzliche Wirkstoffe wie Vitamine oder Proteine, Lichtschutzmittel, Stabilisatoren, Insekten repellentien, Alkohol, Wasser, Salze, antimikrobiell, proteolytisch oder keratolytisch wirksame Substanzen usw.

[0052] Mutatis mutandis gelten entsprechende Anforderungen an die Formulierung medizinischer Zubereitungen.

[0053] Medizinische topische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z. B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

[0054] Entsprechend können kosmetische oder topische dermatologische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzcrème, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotions, Nährcreme, Tages- oder Nachtcreme usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäß Zusammensetzungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden.

[0055] Es ist auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, kosmetische und dermatologische Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z. B. in Tagescremes oder Make-up-Produkten gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet. Auch stellen UV-Schutzsubstanzen, ebenso wie Antioxidantien und, gewünschtenfalls,

[0056] Konservierungsstoffe, einen wirksamen Schutz der Zubereitungen selbst gegen Verderb dar. Günstig sind ferner kosmetische und dermatologische Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen.

[0057] Bevorzugte anorganische Pigmente sind Metalloxide und/oder andere in Wasser schwerlösliche oder unlösliche Metallverbindungen, insbesondere Oxide des Titans (TiO_2), Zinks (ZnO), Eisens (z. B. Fe_2O_3), Zirkoniums (ZrO_2), Siliciums (SiO_2), Mangans (z. B. MnO), Aluminiums (Al_2O_3), Cers (z. B. Ce_2O_3), Mischoxide der entsprechenden Metalle sowie Abmischungen aus solchen Oxiden.

[0058] Solche Pigmente können im Sinne der vorliegenden Erfindung vorteilhaft oberflächlich behandelt ("gecoated") sein, wobei beispielsweise ein amphiphiler oder hydrophober Charakter gebildet werden bzw. erhalten bleiben soll. Diese Oberflächenbehandlung kann darin bestehen, daß die Pigmente nach an sich bekannten Verfahren mit einer dünnen hydrophoben Schicht versehen werden.

[0059] Erfindungsgemäß vorteilhaft sind z. B. Titandioxidpigmente, die mit Octylsilanol beschichtet sind. Geeignete Titandioxidpartikel sind unter der Handelsbezeichnung T805 bei der Firma Degussa erhältlich. Besonders vorteilhaft sind ferner mit Aluminiumstearat beschichtete TiO_2 -Pigmente, z. B. die unter der Handelsbezeichnung MT 100 T bei der Firma TAYCA erhältlichen.

[0060] Eine weitere vorteilhafte Beschichtung der anorganischen Pigmente besteht aus Dimethylpolysiloxan (auch: Dimethicon), einem Gemisch vollmethylierter, linearer Siloxanpolymere, die endständig mit Trimethylsiloxy-Einheiten blockiert sind. Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Zinkoxid-Pigmente, die auf diese Weise beschichtet werden.

[0061] Vorteilhaft ist ferner eine Beschichtung der anorganischen Pigmente mit einem Gemisch aus Dimethylpolysiloxan, insbesondere Dimethylpolysiloxan mit einer durchschnittlichen Kettenlänge von 200 bis 350 Dimethylsiloxan-Einheiten, und Silicagel, welches auch als Simethicone bezeichnet wird. Es ist insbesondere von Vorteil, wenn die anorganischen Pigmente zusätzlich mit Aluminiumhydroxid bzw. Aluminiumoxidhydrat (auch: Alumina, CAS-Nr.: 1333-84-2) beschichtet sind. Besonders vorteilhaft sind Titandioxide, die mit Simethicone und Alumina beschichtet sind, wobei die Beschichtung auch Wasser enthalten kann. Ein Beispiel hierfür ist das unter dem Handelsnamen Eusolex T2000 bei der Firma Merck erhältliche Titandioxid.

[0062] Vorteilhaftes organisches Pigment im Sinne der vorliegenden Erfindung ist das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol) [INCI: Bisoctyltriazol], welches unter der Handelsbezeichnung Tiniosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

[0063] Vorteilhaft enthalten erfindungsgemäß Zubereitungen Substanzen, die UV-Strahlung im UV-A- und/oder UV-B-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 15,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel für Haar oder die Haut dienen.

[0064] Vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Dibenzoylmethanderivate, insbesondere das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan (CAS-Nr. 70356-09-1), welches von Givaudan unter der Marke Parsol® 1789 und von Merck unter der Handelsbezeichnung Eusolex® 9020 verkauft wird.

[0065] Weitere vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen sind die Phenyl-1,4-bis-(2-benzimidazyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und ihre Salze, besonders die entsprechenden Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze, insbesondere das Phenyl-1,4-bis-(2-benzimidazyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure-bis-natriumsalz mit der INCI-Bezeichnung Bisimida-

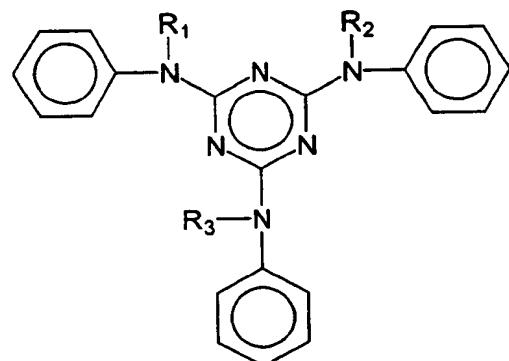
zylate, welches beispielsweise unter der Handelsbezeichnung Neo Heliopan AP bei Haarmann & Reimer erhältlich ist. [0066] Ferner vorteilhaft sind das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und dessen Salze (besonders die entsprechenden 10-Sulfato-Verbindungen, insbesondere das entsprechende Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salz), das auch als Benzol-1,4-di(2-oxo-3-bornylidenmethyl-10-sulfonsäure) bezeichnet wird.

[0067] Vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner sogenannte Breitbandfilter, d. h. Filtersubstanzen, die sowohl UV-A- als auch UV-B-Strahlung absorbieren.

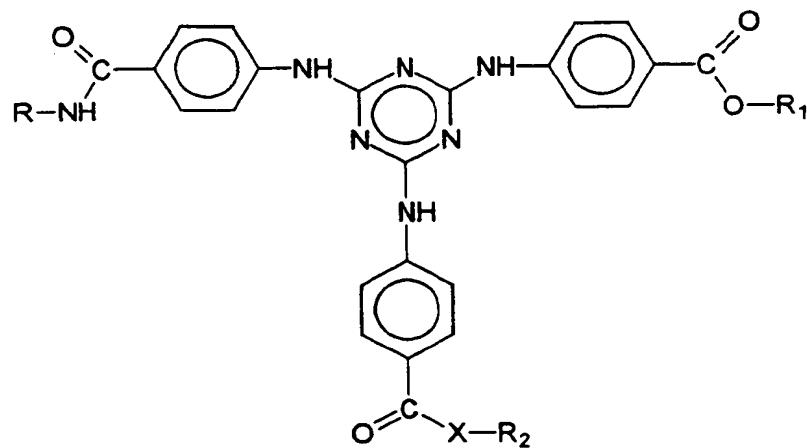
[0068] Vorteilhafte Breitbandfilter oder UV-B-Filtersubstanzen sind beispielsweise Bis-Resorcinyltriazinderivate. Insbesondere bevorzugt sind das 2,4-Bis-[(4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin (INCI: Aniso Triazin), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® S bei der Cliba-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

[0069] Besonders vorteilhafte Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, die sich durch einen hohen bzw. sehr hohen UV-A-Schutz auszeichnen, enthalten bevorzugt mehrere UV-A- und/oder Breitbandfilter, insbesondere Di-benzoylmethanderivate [beispielsweise das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan], Benzotriazolderivate [beispielsweise das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol)], Phenyl-1,4-bis-(2-benzimidazyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und/oder ihre Salze, das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und/oder dessen Salze und/oder das 2,4-Bis-[(4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, jeweils einzeln oder in beliebigen Kombinationen miteinander.

[0070] Auch andere UV-Filtersubstanzen, welche das Strukturmotiv



aufweisen, sind vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung, beispielsweise die in der Europäischen Offenlegungsschrift EP 570 838 A1 beschriebenen s-Triazinderivate, deren chemische Struktur durch die generische Formel



wiedergegeben wird, wobei

R einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen, darstellt,

X ein Sauerstoffatom oder eine N(H)-Gruppe darstellt,

R₁ einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen, oder ein Wasserstoffatom, ein Alkalimetallatom, eine Ammoniumgruppe oder eine Gruppe der Formel

5

10

15

20

25

30

35

40

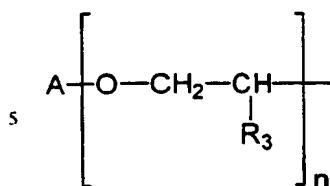
45

50

55

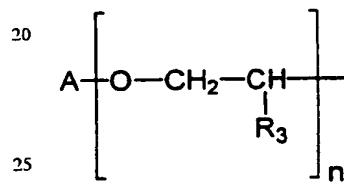
60

65



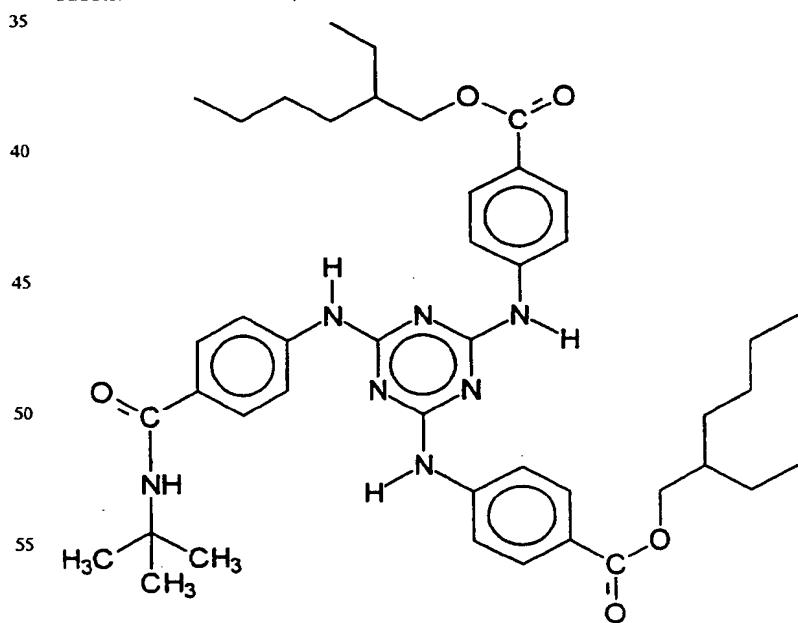
bedeutet, in welcher

10 A einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkyl- oder Arylrest darstellt, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen,
R₃ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe darstellt,
n eine Zahl von 1 bis 10 darstellt,
R₂ einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen, darstellt, wenn X die NH-Gruppe darstellt, und
15 einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen, oder ein Wasserstoffatom, ein Alkalimetallatom, eine Ammoniumgruppe oder eine Gruppe der Formel

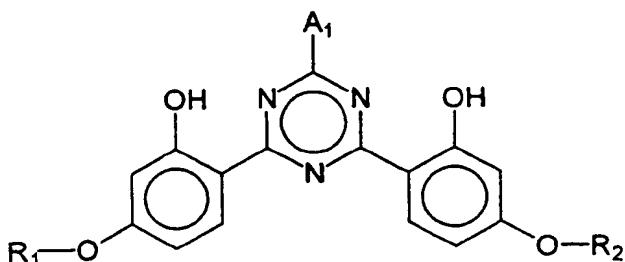


bedeutet, in welcher

A einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkyl- oder Arylrest darstellt, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen,
30 R₃ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe darstellt,
n eine Zahl von 1 bis 10 darstellt,
wenn X ein Sauerstoffatom darstellt.
[0071] Besonders bevorzugte UV-Filtersubstanz im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner ein unsymmetrisch substituiertes s-Triazin, dessen chemische Struktur durch die Formel



60 wiedergegeben wird, welches im Folgenden auch als Dioctylbutylamidotriazon (INCI: Dioctylbutanamidotriazone) bezeichnet wird und unter der Handelsbezeichnung UVASORB HEB bei Sigma 3V erhältlich ist.
[0072] Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung ist auch ein symmetrisch substituiertes s-Triazin, das 4,4',4''-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triylurimino)-tris-benzoësäure-tris(2-ethylhexylester), synonym: 2,4,6-Tris-(anilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy))-1,3,5-triazin (INCI: Octyl Triazole), welches von der BASF Aktiengesellschaft unter der Warenbezeichnung UVINUL® T 150 vertrieben wird.
[0073] Auch in der Europäischen Offenlegungsschrift 775 698 werden bevorzugt einzusetzende Bis-Resorcinyltriazin-derivate beschrieben, deren chemische Struktur durch die generische Formel



5

10

wiedergegeben wird, wobei R₁, R₂ und A₁ verschiedenste organische Reste repräsentieren.

[0074] Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner das 2,4-Bis-[[4-(3-sulfonato)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin Natriumsalz, das 2,4-Bis-[[4-(3-(2-Propyloxy)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[[4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-[4-(2-methoxyethyl-carboxyl)-phenylamino]-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[[4-(3-(2-propyloxy)-2-hydroxypropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-[4-(2-ethyl-carboxyl)-phenylamino]-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[[4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(1-methyl-pyrrol-2-yl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[[4-tris(trimethylsiloxy-silylpropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[[4-(2"-methylpropenoxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin und das 2,4-Bis-[[4-(1',1',1',3',5',5',5'-Heptamethylsiloxy-2"-methylpropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin.

15

[0075] Ein vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

20

[0076] Vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner das 2-(2Hbenzotriazol-2-yl)-4-methyl-6-[2-methyl-3-[1,3,3,3-tetramethyl-1-[(trimethylsilyl)oxy]disiloxanyl]propyl]-phenol (CAS-Nr.: 155633-54-8) mit der INCI-Bzeichnung Dromctrizolc Trisiloxanc.

25

[0077] Die UV-B- und/oder Breitband-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Vorteilhafte öllösliche UV-B- und/oder Breitband-Filtersubstanzen sind z. B.:

30

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- 2,4,6-Trianilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylenbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon
- sowie an Polymere gebundene UV-Filter.

35

40

[0078] Vorteilhafte wasserlösliche UV-B- und/oder Breitband-Filtersubstanzen sind z. B.:

Salze der 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure, wie ihr Natrium-, Kalium- oder ihr Triethanolammonium-Salz, sowie die Sulfonsäure selbst;

45

- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und deren Salze.

[0079] Eine weiterere erfindungsgemäß vorteilhaft zu verwendende Lichtschutzfiltersubstanz ist das Ethylhexyl-2-cyano-3,3-diphenylacrylat (Octocrylen), welches von BASF unter der Bezeichnung Uvinul® N 539 erhältlich ist.

50

[0080] Es kann auch von erheblichem Vorteil sein, polymergebundene oder polymere UV-Filtersubstanzen in Zubereitungen gemäß der vorliegenden Erfindung zu verwenden, insbesondere solche, wie sie in der WO-A-92/20690 beschrieben werden.

[0081] Ferner kann es gegebenenfalls von Vorteil sein, erfindungsgemäß weitere UV-A- und/oder UV-B-Filter in kosmetische oder dermatologische Zubereitungen einzuarbeiten, beispielsweise bestimmte Salicylsäurederivate wie 4-Iso-propylbenzylsalicylat, 2-Ethylhexylsalicylat (= Octylsalicylat), Homomenthylsalicylat.

55

[0082] Die Liste der genannten UV-Filter, die im Sinne der vorliegenden Erfindung eingesetzt werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

[0083] Vorteilhaft enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen die Substanzen, die UV-Strahlung im UV-A- und/oder UV-B-Bereich absorbieren, in einer Gesamtmenge von z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 15,0 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

60

[0084] Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Wirk-, Hilfs- und/oder Zusatzstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z. B. Antioxidativenmittel, Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schämens, Farbstoffe, Pigmente, die färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organischen

65

nische Lösungsmittel oder Silikonderivate.

[0085] Sofern die kosmetische oder dermatologische Zubereitung im Sinne der vorliegenden Erfindung eine Lösung oder Emulsion oder Dispersion darstellt, können als Lösungsmittel verwendet werden:

- 5 – Wasser oder wäßrige Lösungen;
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fetalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- 10 – Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

[0086] Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet. Bei alkoholischen Lösungsmitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

[0087] Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decylolat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyoleat, Oleylerucat, Erucylerucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z. B. Jojobaöl.

[0088] Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silikonöle, der Dialkyläther, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z. B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

[0089] Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

[0090] Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoeicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C₁₂–C₁₅-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

[0091] Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C₁₂–C₁₅-Alkylbenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C₁₂–C₁₅-Alkylbenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C₁₂–C₁₅-Alkylbenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

[0092] Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

[0093] Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

[0094] Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

[0095] Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

[0096] Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z. B. Hyaluronsäure, Xanthanumgummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carboole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

[0097] Erfindungsgemäß verwendete Gele enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin und Wasser bzw. ein vorstehend genanntes Öl in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Polyacrylat ist.

[0098] Feste Stifte enthalten z. B. natürliche oder synthetische Wachse, Fetalkohole oder Fettsäureester.

[0099] Übliche Grundstoffe, welche für die Verwendung als kosmetische Stifte im Sinne der vorliegenden Erfindung geeignet sind, sind flüssige Öle (z. B. Paraffinöle, Ricinusöl, Isopropylmyristat), halbfeste Bestandteile (z. B. Vaseline, Lanolin), feste Bestandteile (z. B. Bienenwachs, Ceresin und Mikrokristalline Wachse bzw. Ozokerit) sowie hochschmelzende Wachse (z. B. Carnaubawachs, Candelillawachs).

DE 101 32 953 A 1

[0100] Als Treibmittel für aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind die üblichen bekannten leichflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden. 5

[0101] Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die Verwirklichung der vorliegenden Erfindung in Form von Aerosolpräparaten geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorkohlenwasserstoffe und Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW). 10

[0102] Kosmetische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können auch als Gele vorliegen, die neben einem wirksamen Gehalt am erfindungsgemäßen Wirkstoff und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln, bevorzugt Wasser, noch organische Verdickungsmittel, z. B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Cellulose-Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z. B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise Bentonite, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolstearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist in dem Gel z. B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten. 15

[0103] Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

DE 101 32 953 A 1

1. PIT-Emulsionen

		1	2	3	4	5
5	Glycerinmonostearat selbstemulgierend	0,50		3,00	2,00	4,00
	Polyoxyethylen(12)cetylstearyl ether		5,00		1,00	1,50
10	Polyoxyethylen(20)cetylstearyl ether				2,00	
	Polyoxyethylen(30)cetylstearyl ether	5,00		1,00		
15	Stearylalkohol			3,00		0,50
	Cetylalkohol	2,50	1,00		1,50	
20	2-Ethylhexyl Methoxizinnamat				5,00	8,00
	2,4-Bis-(4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxyl)-phenyl)-6-(4-methoxyphenyl)-(1,3,5)-triazin		1,50		2,00	2,50
25	1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)-1,3-propandion			2,00		
	Diethylhexyl Butamidotriazon	1,00	2,00		2,00	
30	Ethylhexyl Triazon	4,00		3,00	4,00	
	4-Methylbenzyliden Campher		4,00			2,00
35	Octocrylen		4,00			2,50
	Phenyl-1,4-bis-(mononatrium, 2-benzimidazyl-5,7-disulfonsaeure			0,50		1,50
40	Phenylbenzimidazol Sulfonsäure	0,50			3,00	
	C12-15 Alkyl Benzoat		2,50			5,00
45	Titandioxid	0,50	1,00		3,00	2,00
	Zinkoxid	2,00		3,00	0,50	1,00
50	Dicaprylylether			3,50		
	Butylenglycol-Dicaprylat/-Dicaprat	5,00			6,00	
55	Dicaprylycarbonat			6,00		2,00
	Dimethicon Polydimethylsiloxan		0,50	1,00		
60	Phenylmethylpolysiloxan	2,00			0,50	0,50
	Shea-Butter (Sheabutter)		2,00			0,50
	PVP Hexadencopolymer	0,50			0,50	1,00
	Glycerin	3,00	7,50	5,00	7,50	2,50
	Tocopherolacetat	0,50		0,25		1,00
	Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	0,10	0,50	1,00	0,20	0,10

Alpha-Glucosylrutin	0,10		0,20		
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Ethanol	3,00	2,00	1,50		1,00
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad. 100	ad. 100	ad. 100	ad. 100	ad. 100

2. Beispiele O/W-Crème

Beispiele	1	2	3	4	5
Glycerylstearatcitrat			2,00		2,00
Glycerylsterat selbstemulgierend	4,00	3,00			
PEG-40-Stearat	1,00				
Polyglyceryl-3-Methylglucose-Distearat				3,00	
Sorbitanstearat					2,00
Stearinsäure		1,00			
Polyoxyethylen(20)-cetylstearyl ether					
Stearylalkohol			5,00		
Cetylalkohol	3,00	2,00		3,00	
Cetylstearylalkohol					2,00
C12-15 Alkybenzoat					
Caprylic-/Capric-Triglycerid	5,00	3,00	4,00	3,00	3,00
Octyldodecanol			2,00		2,00
Dicaprylylether		4,00		2,00	1,00
Paraffinum liquidum	5,00	2,00		3,00	
Titandioxid			1,00		
4-Methylbenzyliden Campher			1,00		
1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)- 1,3-propandion			0,50		
Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	0,20	0,50	0,10	1,00	0,30
Tocopherol	0,1				0,20
Biotin			0,05		
Ethylendiamintetraessigsäure Trinatrium	0,1		0,10	0,1	

Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Xanthan Gummi					
Polyacrylsaeure	3,00	0,1		0,1	0,1
Natronlauge 45%	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	5,00	3,00	4,00	3,00	3,00
Butylenglycol		3,00			
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100				

3. Beispiele O/W-Crème

Beispiele	6	7	8	9	10
Glycerylstearatcitrat		2,00	2,00		
Glycerylsterat selbstemulgierend	5,00				
Stearinsäure				2,50	3,50
Stearylalkohol	2,00				
Cetylalkohol				3,00	4,50
Cetylstearylalkohol		3,00	1,00		0,50
C12-15 Alkylbenzoat		2,00	3,00		
Caprylic-/Capric-Triglycerid	2,00				
Octyldodecanol	2,00	2,00		4,00	6,00
Dicaprylylether					
Paraffinum liquidum		4,00	2,00		
Cyclisches Dimethylpolysiloxan				0,50	2,00
Dimethicon Polydimethylsiloxan	2,00				
Titandioxid	2,00				
4-Methylbenzyliden Campher	1,00				1,00
1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)-	0,50				0,50
1,3-propandion					
Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	0,20	0,70	0,25	1,00	0,40
Tocopherol					0,05
Ethylendiamintetraessigsaeure Trinatrium			0,20		0,20

Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Xanthan Gummi			0,20		
Polyacrylsaeure	0,15	0,1		0,05	0,05
Natronlauge 45%	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	3,00		3,00	5,00	3,00
Butylenglycol		3,00			
Ethanol		3,00		3,00	
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	Ad 100				

4. Beispiele W/O-Emulsionen

	1	2	3	4	5
Cetyltrimethiconcopolyol		2,50		4,00	
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	5,00				4,50
PEG-30-dipolyhydroxystearat			5,00		
2-Ethylhexyl Methoxizinnamat		8,00		5,00	4,00
2,4-Bis-(4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxyl)-phenyl)-6-(4-methoxyphenyl)-(1,3,5)-triazin	2,00	2,50		2,00	2,50
1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)-1,3-propandion			2,00	1,00	
Diethylhexyl Butamidotriazon	3,00	1,00			3,00
Ethylhexyl Triazon			3,00	4,00	
4-Methylbenzyliden Campher		2,00		4,00	2,00
Octocrylen	7,00	2,50	4,00		2,50
Diethylhexyl Butamidotriazon	1,00			2,00	
Phenyl-1,4-bis-(mononatrium, 2-benzimidazyl-5,7-disulfonsaeure)	1,00	2,00	0,50		
Phenylbenzimidazol Sulfonsäure	0,50			3,00	2,00
Titandioxid		2,00	1,50		3,00
Zinkoxid	3,00	1,00	2,00	0,50	
Paraffinum liquidum			10,0		8,00
C12-15 Alkyl-Benzoat				9,00	

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

5	Dicaprylylether	10,00				7,00
10	Butylen-Glycol-Dicaprylat/-Dicaprat			2,00	8,00	4,00
15	Dicaprylylcarbonat	5,00		6,00		
20	Dimethicon Polydimethylsiloxan		4,00	1,00	5,00	
25	Phenylmethylpolysiloxan	2,00	25,00			2,00
30	Shea Butter			3,00		
35	PVP Hexadecencopolymer	0,50			0,50	1,00
40	Octoxyglycerin		0,30	1,00		0,50
45	Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
50	Glycinsoja		1,00	1,50		
55	Magnesiumsulfat	1,00	0,50		0,50	
60	Magnesiumchlorid			1,00		0,70
65	Tocopherolacetat	0,50		0,25		1,00
70	Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	0,10	0,60	1,00	1,00	0,80
75	Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
80	Ethanol	3,00		1,50		1,00
85	Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
90	Wasser	ad:	ad.	ad.	ad.	ad.
95		100	100	100	100	100

5. Beispiele W/O-Emulsionen

40		6	7
45	Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	4,00	5,00
50	PEG-30-dipolyhydroxystearat		
55	Lanolinalkohol	0,50	1,50
60	Isohexadecan	1,00	2,00
65	Myristyl-Myristat	0,50	1,50
70	Vaseline	1,00	2,00
75	1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)- 1,3-propandion	0,50	1,50
80	4-Methylbenzyliden Campher	1,00	3,00
85	Butylen-Glycol-Dicaprylat/-Dicaprat	4,00	5,00

DE 101 32 953 A 1

Shea Butter		0,50
Butyenglycol		6,00
Octoxyglycerin		3,00
Glycerin	5,00	
Tocopherolacetat	0,50	1,00
Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	0,20	0,25
Trisodium EDTA	0,20	0,20
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.
Ethanol		3,00
Parfum	q.s.	q.s.
Wasser	ad. 100	ad. 100

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

DE 101 32 953 A 1

6. Beispiele Hydrodispersionen

	1	2	3	4	5
5 Polyoxyethylen(20)cetylstearylether	1,00			0,5	
Cetylalkohol			1,00		
Natriumpolyacrylat		0,20		0,30	
10 Acrylate /C10-30-Alkyl-Acrylat Crosspolymer	0,50		0,40	0,10	0,10
Xanthan Gummi		0,30	0,15		0,50
15 2-Ethylhexyl Methoxyzinnamat				5,00	8,00
20 2,4-Bis-(4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxyl)-phenyl)-6-(4-methoxyphenyl)-(1,3,5)-triazin		1,50		2,00	2,50
25 1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphe-nyl)-1,3-propandion	1,00		2,00		
Diethylhexyl Butamidotriazon		2,00		2,00	1,00
Ethylhexyl Triazon	4,00		3,00	4,00	
30 4-Methylbenzyliden Campher	4,00	4,00			2,00
Octocrylen		4,00	4,00		2,50
35 Phenyle-1,4-bis-(mononatrium, 2-benz-imidazyl-5,7-disulfonsaeure	1,00		0,50		2,00
Phenylbenzimidazol Sulfonsäure	0,50			3,00	
40 Titandioxid	0,50		2,00	3,00	1,00
Zinkoxid	0,50	1,00	3,00		2,00
45 C12-15 Alkyl Benzoat	2,00	2,50			
Dicaprylylether		4,00			
50 Butylenglycol-Dicaprylat/-Dicaprat	4,00		2,00	6,00	
Dicaprylylcarbonat		2,00	6,00		
55 Dimethicon Polymethylsiloxan		0,50	1,00		
Phenylmethylpolysiloxan	2,00			0,50	2,00
Shea Butter		2,00			
60 PVP Hexadencopolymer	0,50			0,50	1,00
Octoxyglycerin			1,00		0,50
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50

Glycinsoja			1,50		
Tocopherolacetat	0,50		0,25		1,00
Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	0,15	0,60	1,00	1,00	0,80
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Ethanol	3,00	2,00	1,50		1,00
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad. 100	ad.	ad.	ad. 100	ad.
		100	100		100

7. Beispiel (Gelcrème)

Acrylat /C10-30 Alkylacrylat Crosspolymer	0,40	20
Polyacrylsaeure	0,20	
Xanthan Gummi	0,10	25
Cetearylalkohol	3,00	
C12-15 Alkylbenzoat	4,00	
Caprylic/Capric Triglycerid	3,00	30
Cyclisches Dimethylpolysiloxan	5,00	
Dimeticon Polydimethylsiloxan	1,00	
Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	0,20	35
Glycerin	3,00	
Natriumhydroxid	q.s.	
Konservierungsmittel	q.s.	40
Parfum	q.s.	
Wasser	ad 100,0	45
pH-Wert eingestellt auf 6.0		

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

DE 101 32 953 A 1

8. Beispiel (W/O-Crème)

5	Polyglyceryl-3-Diisostearate	3,50
10	Glycerin	3,00
15	Polyglyceryl-2-Dipolyhydroxystearate	3,50
20	Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	0,50
25	Konservierungsmittel	q.s.
30	Parfum	q.s.
35	Wasser	ad 100,0
40	Magnesiumsulfat	0,6
45	Isopropylstearat	2,0
50	Caprylylether	8,0
	Cetearylisononanoat	6,0

9. Beispiel (W/O/W-Crème)

25	Glycerylstearat	3,00
30	PEG-100-Stearat	0,75
35	Behenylalkohol	2,00
40	Caprylic-/Capric-Triglycerid	8,0
45	Octyldodecanol	5,00
50	C ₁₂₋₁₅ Alkylbenzoat	3,00
	Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	1,00
	Magnesiumsulfat (MgSO ₄)	0,80
	Ethylendiamintetraessigsäure	0,10
	Konservierungsmittel	q.s.
	Parfum	q.s.
	Wasser	ad 100,0
	pH-Wert eingestellt auf 6.0	

55

60

65

DE 101 32 953 A 1

10. Beispiel W/O-Stift

PEG-45/Dodecylglycolcopolymer	2,00	5
Polyglyceryl-3Diisostearat	2,00	
Caprylic-/Capric-Triglycerid	4,00	
Cetearylisononanoat	4,00	10
Butylenglycol-Dicaprylat/-Dicaprat	5,00	
Ethylhexyl Methoxycinnamat	5,00	
Ethylhexyl Triazon	3,00	15
Bis-Ethylhexyloxyphenol Methoxyphenyl Triazin	2,50	
Hombitec H	2,00	20
C20-40Alkylstearat	9,00	
Silicadimethylsilylat	1,00	
Dimethicon	0,50	25
Glycerin	10,00	
Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	0,20	30
PVP/Hexadecencopolymer	0,50	
 Tocopherolacetat	1,00	35
Konservierungsmittel	q.s.	
Parfum	q.s.	
Wasser	ad 100	40

11. Beispiel W/O-Stift

PEG-45/Dodecylglycolcopolymer	2,00	45
Polyglyceryl-3-Diisostearat	2,00	
Cetearylisononanoat	15,00	
C20-40-Alkyl-Stearat	8,00	50
Glycerin	10,00	
Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt	0,50	
Konservierungsmittel	q.s.	
Parfum	q.s.	
Wasser	Ad 100,00	60

Patentansprüche

1. Verwendung von Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakten in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome umweltbedingter negativer Hautveränderungen und/oder durch UV- und/oder Ozon- und/oder Smog und/oder Rauchen induzierten Hautschäden sowie entzündlicher und degenerative

65

DE 101 32 953 A 1

rativer Hautzuständen.

2. Verwendung nach Anspruch 1, wobei die Hautschäden ein oder mehrere Erscheinungsbilder aus der Gruppe defizitäre, sensitive oder hypoaktive Hautzustände oder defizitäre, sensitive oder hypoaktive Zustände von Hautanhängsgebilden,

5 degenerative Erscheinungen der Haut:

Hautfalten, Fältchen, Altersflecken, Teleangiektasien, Hautschlaffheit, Elastizitätsverlust sowie Schwund der epidermalen und dermalen Zellschichten, der Bestandteile des Bindegewebes, der Retezapfen und Kapillargefäße und/oder der Hautanhängsgebilde,

10 umweltbedingte, durch Rauchen, Smog, reaktive Sauerstoffspezies, freie Radikale verursachte und/oder lichtbedingte negative Veränderungen der Haut und der Hautanhängsgebilde,

lichtbedingte Hautschäden und UV-induzierte Immunsuppression,

Verringerung der Hautdicke,

Hauterschlaffung und/oder Hautermüdung,

Störungen des normalen Haut-pH's und der Osmolytbalance,

15 Pigmentierungsstörungen,

Juckreiz,

Hornschichtbarrierestörungen,

Veränderungen des transepidermalen Wasserverlustes und des normalen Feuchtigkeitsgehaltes der Haut,

Veränderungen der normalen Lipidperoxidationen,

20 Abweichungen von der normalen Zell-Zell-Kommunikation in der Haut,

Veränderungen der normalen Fibroblasten- und Keratinozytenproliferation,

Veränderungen der normalen Fibroblasten- und Keratinozytentdifferenzierung,

Haarausfall und für verbessertes Haarwachstum,

entzündliche Hautzustände,

25 atopisches Ekzem, seborrhoisches Ekzem, polymorphe Lichtdermatose, Psoriasis, Vitiligo,

Wundheilungsstörungen,

empfindliche oder gereizte Haut,

Störungen der normalen Kollagen-, Hyaluronsäure-, Elastin- und Glykosaminoglycan-Homeostase,

gesteigerter Aktivierung proteolytischer Enzyme in der Haut wie z. B. Metalloproteinasen,

30 Mängelscheinungen der intrazellulären DNS-Synthese, insbesondere bei defizitären oder hypoaktiven Hautzuständen, und DNS-Reparatur bzw. zur Steigerung der hauteigenen Schutz- und Reparaturmechanismen (beispielsweise für dysfunktionelle Enzyme, DNA, Lipide, Proteine),

zur Beruhigung von empfindlicher oder gereizter Haut,

zur Steigerung der Zellerneuerung und Regeneration der Haut

35 darstellen.

3. Verwendung nach Anspruch 1, wobei die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen 0,0005 bis 50 Gew.-%, bevorzugt 0,01 bis 20 Gew.-%, insbesondere 0,01 bis 5 Gew.-% an Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakten enthalten, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

4. Verwendung nach Anspruch 1, wobei die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen sich durch einen zusätzlichen Gehalt an einem oder mehreren der folgenden natürlichen Wirkstoffe und/oder deren Derivaten auszeichnen: alpha-Liponsäure, Phytoen, D-Biotin, Coenzym Q10, alpha Glucosyrlutin, Carnitin, Carnosin, Isoflavone, Klee-Extrakte, Soja-Extrakte, Kreatin, Taurin.

5. Verwendung nach Anspruch 1, wobei der Gehalt der zusätzlichen Wirkstoffe aus dem Bereich von 0,0001 bis 30 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung, gewählt wird.

45

50

55

60

65